

⑫ 公開特許公報(A)

昭64-70409

⑬ Int. Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和64年(1989)3月15日

A 61 K 7/32
9/506971-4C
V-6742-4C

審査請求 未請求 請求項の数 18 (全13頁)

⑮ 発明の名称 皮膚処置組成物

⑯ 特 願 昭63-201797

⑰ 出 願 昭63(1988)8月12日

優先権主張 ⑱ 1987年8月12日 ⑲ イギリス(GB) ⑳ 8719091

㉑ 発 明 者 ゴードン・ロバート・ イギリス国、マージサンド・エル・62・2・エイ・ビ
ワイト ー、ウィラル、スピタル、バンダーバイル・アペニュー・
4㉒ 出 願 人 ユニリーバー・ナーム オランダ国、ロッテルダム、バージミスターズ・ヤコブ
ローゼ・ベンノートシ プレーン・1
ヤープ

㉓ 代 理 人 弁理士 川口 義雄 外2名

明 細 書

1. 発明の名称

皮膚処置組成物

2. 特許請求の範囲

(1) (i) 感湿性カプセル0.1~20重量%、及び

(ii) C₂-6アルカノール及びそれらの混合物から

選択されるアルコール10~99.9重量%、

を含有し且つ3重量%以下の水を含有する、ヒト
の皮膚に局所的に施用するのに適したアルコール
組成物であって、前記感湿性カプセルが、平均粒
径100μm以下を有し且つポリマーによって封入さ
れている非水性物質を含有しており、更に前記カ
プセルが、(a) 1重量%以下の水を含有するエタノールを
用いて20℃で30日間にわたる無傷カプセルの連続
抽出の間、当初カプセル内に存在した非水性物質
の15重量%以下がカプセルから浸出するようなア
ルコールを用いた抽出に対する耐性があり、且つ(b) 皮膚表面で水と接触したときにカプセルが
封入非水性物質を放出するような水分に対する感
度があることを特徴とする組成物。(2) ポリマーが、非水性物質の10重量%以下が
カプセルから浸出されるようなアルコールを用い
た抽出に耐性があることを特徴とする請求項1に
記載の組成物。(3) ポリマーが多環類であることを特徴とする
請求項1又は2に記載の方法。(4) ポリマーがデキストリンであることを特徴
とする請求項1、2又は3のいずれか一項に記載
の組成物。(5) デキストリンが、20rpmで螺旋形に回転す
る「A」型Tバーを備えたブルックフィールド粘度計
を使用して測定すると、水の50%分散液では25℃
で330±20mPasの粘度を有することを特徴とする
請求項4に記載の組成物。

(6) ポリマーがアラビアゴムであることを特徴

とする請求項1、2又は3のいずれか一項に記載の組成物。

(7) 封入非水性物質が香料であることを特徴とする請求項1～6のいずれか一項に記載の組成物。

(8) 封入非水性物質がクラーントであることを特徴とする請求項1～6のいずれか一項に記載の組成物。

(9) 非水性物質を、皮膚緩和剤、香料以外の脱臭剤、発汗抑制剤、抗コリン作用薬及びこれらの混合物から選択することを特徴とする請求項1～8のいずれか一項に記載の組成物。

(10) アルカノールを、エタノール、イソプロパノール及びこれらの混合物から選択することを特徴とする請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物。

(11) 更に懸濁剤を含有することを特徴とする請求項1～10のいずれか一項に記載の組成物。

(12) 懸濁剤が陳水処理をした粘土であることを

特徴とする請求項11に記載の組成物。

(13) 懸濁剤がヒドロキシプロピルセルロースであることを特徴とする請求項11に記載の組成物。

(14) 懸濁剤がジベンジルソルビトールであることを特徴とする請求項11に記載の組成物。

(15) 感湿性カプセルに加えて更に発汗抑制剤、れん性金属塩を含有することを特徴とする請求項1～14のいずれか一項に記載の組成物。

(16) 感湿性カプセルに加えて更に殺菌剤を含有することを特徴とする請求項1～15のいずれか一項に記載の組成物。

(17) 感湿性カプセルに加えて更に抗コリン作用薬を含有することを特徴とする請求項1～16のいずれか一項に記載の組成物。

(18) エタノール、イソプロパノール又はこれらの混合物から選択したアルカノール中に感湿性カプセルと懸濁剤を懸濁させ、次いでこのように得られる組成物を包装するステップから成ることを特

-3-

徴とし、3重量%以下の水を含有する請求項1～15のいずれか一項に記載の組成物を調製する方法。

3. 発明の詳細な説明

発明の分野

本発明はヒトの皮膚に局所的に施用するのに適した脱臭及び発汗抑制組成物に関し、該組成物は知覚的信号を生成し及び/又は、皮膚の水分と接触したときに、脱臭剤、発汗抑制剤又は抗コリン作用活性物質といった他の有効な薬剤を放出するようにしてある。知覚的信号を生成するこれらの組成物は、皮膚上の水分に反応していることを使用者に表示するようにしてあり、そうするとこれらの組成物に意図された機能における個人的な信頼が増大する。

従来技術の背景

体臭の問題は少なくとも部分的には発汗に関係しており、この問題に取り組むために、ヒトの皮膚、特に腋下に局所的に施用するための脱臭特性

-4-

を有するエアゾル、ローラーオン及び棒状製品が開発されてきた。

発汗抑制製品は通常皮膚表面に集積する汗の量を低減するための収れん金属塩等を含有し、脱臭製品は通常、皮膚の水分の存在下に発達する体臭を低減又は消失させるための抗菌性物質を含有する。いずれのタイプの製品も、発汗抑制剤及び脱臭剤のためのビヒクルとしての機能だけでなく、それ自体脱臭剤として作用することができるエタノールを含有することができる。

脱臭剤及び発汗抑制製品の使用者が、それらを使用したことで体臭又は発汗が実質的に低減又は消失されることを確信することは重要であって、このことから、このような製品が実際に効果を発揮していることを示す知覚応答を提供することが有利である。

この点では、The Mennen Companyは、英国特許第1 275 969号明細書において、エアゾル脱臭剤

-5-

-45-

-6-

に使用するための香料を含有するデキストリン、アラビアゴム若しくは薄膜形成ポリペプチドの噴霧乾燥脱臭剤カプセルの使用を提案しており、該カプセルは水溶性であるがエアゾル推進薬には不溶性及び不浸透性である。エアゾル脱臭剤を調製する場合は、例えばアラビアゴムでできており香料及びヘキサクロロフェンを含有する脱臭剤カプセルを、エアゾル推進剤及び懸濁剤を包含する残りの成分と混合して発汗応答エアゾル脱臭剤を製造する。しかしHennen名義の明細書には、「アルコール(即ちエタノール等)は多くの場合カプセルからその封入物を浸出させてカプセルの主目的を無効にするので、最終薬剤はその他のほぼ全てのエアゾル脱臭剤に存在する実質的な量のアルコールを含有するべきでない。」という明確な指示がある。

International Flavours & Fragrancesは米国特許第4 428 869号明細書において、例えば水

-7-

で報告されている非安定性は、無水状態又は無水に近い状態のエタノールを維持するために厳重な予防策を取らないのであれば脱臭剤業界において使用するような、アルコール中に一般的に存在する少量ではあるが重要な量の水に因るものであろう。Hennenの明細書では触れてはいないが、使用するエタノール中の少量の、例えば5重量%の水は、香料及び殺菌剤がエタノールによって容易に浸出されるようにカプセルを破壊するために非常に重要であることに留意された。

また少なくとも5%の水を含有する前記参照したInternational Flavours & Fragrancesが示唆するヒドロアルコール系を使用する場合でも同様の結果となろう。

これは、「最終薬剤は実質的な量のアルコールを含有するべきではない」ということのHennenの警告の論理的な説明に過ぎない。

発明の定義

アルコール混合物が80~95%のアルコールを含有することができるヒドロアルコール系において使用するためのアラビアゴム(gum acacia)における封入芳香性油に関する。

皮膚表面での水分の出現を示すための知覚応答を生成でき及び/又は同じメカニズムによって誘発される他の有効剤を放出できる、皮膚に局所的に施用するためのアルコール含有発汗抑制剤及び脱臭剤製品を開発するための努力をしているうちに、本出願人は特にHennenの明細書から期待されることに反して、アラビアゴム(gum arabic又は gum senegalとも指称される)と一緒に噴霧乾燥することによって封入された香料が、室温で長時間無水エタノールを用いて連続抽出するテストをした場合にエタノールでの浸出に耐性耐性を示すことを発見した。エタノール中のカプセルのこの驚くべき安定性は実質的に無水なエタノールを使用することに因るもので、一方Hennenの明細書中

-8-

本発明は、

- (i) 感湿性カプセル0.1~20重量%、及び
- (ii) C₁₂アルコール及びそれらの混合物から選択されるアルコール10~99.9重量%、を含有し且つ3重量%以下の水を含有する、ヒトの皮膚に局所的に施用するのに適したアルコール組成物であって、前記感湿性カプセルは平均粒径100 μ m以下を有し且つポリマーによって封入された非水性物質を含有しており、更に前記カプセルが、
 - (a) 3重量%以下の水を含有するエタノールを用いて20℃で30日間にわたる無傷カプセルの連続抽出の間、当初カプセル内に存在した非水性物質の15重量%以下がカプセルから浸出するようなアルコールを用いた抽出に対する耐性があり、且つ
 - (b) 皮膚表面で水と接触したときにカプセルが封入非水性物質を放出するような水分に対する感度がある組成物に関する。

感湿性カプセル

本発明のアルコール組成物は、組成物が3重量%以下の水を含有してしかも本明細書中に定義するように感湿性であるという条件で、アルコールによる破壊に耐性がある被覆を形成する特殊ポリマーによって中に非水性物質が封入されている感湿性カプセルを含有する。

特殊ポリマー

カプセルを形成する特殊ポリマーは好ましくは多糖類である。適当な多糖類の例としては、デキストリン、特にマルトデキストリンを包含する低粘度デキストリンを挙げることができる。

特に好ましい低粘度デキストリンは、20rpmで螺旋形に回転する「A」型Tバーを備えたブルックフィールド粘度計を使用して測定すると、水の50%分散液において25℃で330±20mPasesの粘度を有するものである。このデキストリンはEncapsul 855(Encapsul 855とも指称される)として公知であつ

て、National Starch and Chemicals Ltd.製である。

感湿性カプセルを形成するのに使用することができる他の多糖類としてはアラビアゴムが例示される。

非水性物質

感湿性カプセルは非水性物質を含有するが、この非水性物質は水分の存在下、特に発汗又はその他の皮膚水分によるカプセルの破壊後に知覚応答を与えることができる物質が好ましい。

カプセルが水分と接触してカプセルから放出されたときに知覚応答を与えることができる非水性物質の例としては、

- (i) 芳香形態で臭覚応答を生じる香料、及び、米国特許第4 278 658号明細書(Lever Brothers & Co)に記述してあるような芳香応答を与えることに加えて体臭を低減することもできる脱臭香料
- (ii) 皮膚の冷感形態の触覚応答を生じるスキン

-11-

クーラント(例えばメントール、乳酸メチル、メチルピロリドンカルボキシレート、N-エチル-p-メンタン-3-カルボキサミド及び他のメントール誘導体)、並びに

- (iii) 皮膚の潤滑性を増す形態の触覚応答を生じる皮膚緩和剤(例えばイソプロピルミリスデート、シリコーン油、鉱油及び植物油)、を挙げることができる。

その他の皮膚に有益な非水性物質の例としては以下のものを挙げることができる。

- (iv) 特に体臭の発達の原因となる皮膚表面の微生物叢の量を低減又は微生物叢を消失させる機能がある香料以外の脱臭剤(例えば、2,4,4'-トリクロロ-2'-ヒドロキシジフェニルエーテル(Irgasan DP300又はTrielosanとして公知)、セチルトリメチルアンモニウムブロミド、セチルピリジニウムクロリド、ベンゼトニウムクロリド、ジ-イソブチルフェノキシエチルジメチルベンジルア

-12-

ンモニウムクロリド、N-アルキルピリジニウムクロリド、N-セチルピリジニウムブロミド、ナトリウム-N-ラウロイルサルコシン、フェニルホルン酸亜鉛、ファルネゾール及び乳酸エチル)、香料以外の脱臭剤の前駆体を使用することもできる。

- (v) 皮膚表面の汗の出現を低減又は消失させる機能がある発汗抑制剤(例えば、塩化アルミニウム;硫酸アルミニウム;塩基性真化アルミニウム;塩化ジルコニル;水酸化ジルコニル;塩酸ジルコニル;水酸化アルミニウム、塩化ジルコニル及び塩酸アルミニウムの錯体;水酸化アルミニウム、塩酸ジルコニル及び塩酸アルミニウムの錯体;ジヒドロキシアルミニウムグリシネート、塩化ジルコニル及び/若しくは塩酸ジルコニル並びに塩酸アルミニウムの錯体;塩化ジルコニル及び/若しくは塩酸アルミニウムの錯体;塩化ジルコニル及び/若しくは塩酸ジルコニルと塩酸アルミニウム及びアミノ酸

(例えばグリシン)との錯体;上記2種以上の物質の混合物)。最も好ましい材料は高発汗抑制効果を有する材料である。このような材料のクラスの1つには塩酸アルミニウムジルコニウム錯体(例えば、アルミニウムジルコニウムトリクロロヒドレート;アルミニウムジルコニウムテトラクロロヒドレート及びアルミニウムジルコニウムベンタクロロヒドレート(これらは属名CTFAである))がある。これらの化合物をグリシンと結合させて、例えば属名CTFAの化合物アルミニウムジルコニウムトリクロロヒドレックス-GLY及びアルミニウムジルコニウムテトラクロロヒドレックス-GLYを調製することができる。アルミニウムジルコニウムクロロヒドレートを調製する方法は米国特許第4 028 390号(Armour)及び第3 792 088号(Procter & Gamble)の各明細書に記述されている。本発明の発汗抑制組成物に使用するのに適当な塩酸アルミニウムジルコニウム粉末は、Reheis Chemical

社製の商品名REZAL 36 GP及びREZAL 67P(REZALは商標名である)と、Bow Corning製の商品名Bow Corning AZG-368、AZG-369&AZG-370とである。

その他の好ましい高効能の発汗抑制剤材料は、水溶液中でポリマー種が特定の分散をする特殊活性形態の塩基性塩化アルミニウムであって、米国特許第4 359 456号明細書(Gesling et al.)に記述されている方法によって調製することができる。水性媒質中で塩酸アルミニウムをエー징させ、高活性形態の塩酸アルミニウムを製造する同様の方法は、英国特許第2 144 992号明細書(Gillette)に記述されている。発汗抑制剤は、欧州特許第6738号(Unilever)及び英国特許第1 597 497号(Unilever)の各明細書に記述の方法で調製される塩酸アルミニウムの尿素又はグリシンの錯体であってもよい。

(vi) 汗が皮膚表面に到達する前に汗の生成を低減又は消失させる機能を有する抗コリン作用薬で

-15-

あって、その例としては、スコポラミン誘導体(例えばスコポラミンヒドロブロミド)及びそのエステル(例えばベンゾイルスコポラミンヒドロブロミド)を挙げることができる。

本明細書中に記述したような非水性物質は混合して使用することもできる。このような混合物としては、

香料+非香料脱臭剤、

香料+抗コリン作用薬、

香料+抗コリン作用薬+発汗抑制剤、

香料+クラーラント、

を例示することができる。

カプセルのカプセル材料を形成する特殊ポリマーの非水性物質に対する重量比は、好ましくは1:10~100:1、最も好ましくは1:4~9:1である。

感湿性カプセルの形成

例えば、水、特殊ポリマー及び非水性物質のエマルジョンを調製し、そのエマルジョン中にカプ

-16-

セル内に包含させる必要があるその他の材料を溶解又は拡散させることによって、感湿性カプセルを形成することができる。次いでエマルジョンは、封入物を含有するポリマーのカプセルを形成するための通常の方法に従って噴霧乾燥される。

例えば感湿性カプセルは、20~40重量%、好ましくは23~36重量%の特殊ポリマーと、5~30重量%、好ましくは7~29重量%の非水性物質と、40~70重量%、好ましくは43~65重量%の水とを含有するエマルジョンを形成し、次いでこのエマルジョンを噴霧乾燥することによって調製することができる。

このように調製された感湿性カプセルは、40~90重量%の特殊ポリマーによって封入された約10~60重量%の非水性物質を含有する。しかし、感湿性カプセルが、本明細書中前記した最適な範囲外の量の非水性物質及び特殊ポリマーを含有してもよいことは理解される。

これは特に、非水性物質が例えばスキングラント又は抗コリン作用薬といった少量で高活性の生理学的活性剤の場合に当てはまる。

感湿性カプセルの特性

このように形成されるカプセルは、特に皮膚表面で水分に接触したときに溶解できるか又は浸透性になり得て封入非水性物質を放出するが、3重量%以下の水を含有するエタノール組成物と接触したときには耐性を示すことは望むべきことである。例えば、非水性物質として香料を含有するアラビアガムのカプセル若しくはEncapsul 855を、1重量%以下の水を含有するエタノールを用いて20℃で30日間連続的に抽出する場合に、新たに調製されたカプセル内に当初存在した香料全体の15%以下しかこの間に浸出されないことが分かった。このことは、先に参照したNennen社による英国特許第1 275 969号に報告されていることは全く相反する。しかしこのアラビアガムの顕著な特性

は、Capsul starch(National Starch and Chemical Corp.製)及び β -シクロデキストリンといったより一般的な封入材料には見られず、1ヶ月にわたって(やはり1重量%以下の水を含有する)エタノールを用いて抽出すると香料の72~100%が浸出した。アラビアゴム以外の天然ゴムは、無傷安定性カプセルを形成するに必要とされる濃度で噴霧乾燥するには媒質の粘度が高すぎる傾向にあるので、本明細書に記述したような感湿性カプセルを形成するための噴霧乾燥の材料として実用的ではない。

この抽出テストは、詳細は後記するが、本発明に使用するためのポリマーの適合性を評価するための標準的なテストとして使用される。

選択するポリマーは、本明細書中に定義するように1重量%以下の水を含有するエタノールを用いる抽出条件下で、カプセル材料が香料の10重量%以下しか浸出させないようなものであるのが好

-19-

ましい、好ましいポリマーとして前記した低粘度重量のデキストリン及びアラビアゴムはこの特性を有する。

感湿性カプセルは通常 100μ 以下の平均粒径を有する。通常、特にエアゾルディスペンサーを用いるがノズルの詰まりを防止したい場合にはカプセルは平均粒径 $20\sim 75\mu$ とする。

本発明のアルコール組成物中に存在する感湿性カプセルの量は、組成物の0.1~20重量%、好ましくは0.2~15重量%である。

アルコール

本発明の組成物は、 C_{2-6} アルカノール及びその混合物から選択されるアルコールをも含有する。好ましいアルコールはエタノール及びイソプロパノールである。

アルコールは3重量%以下の水を含有すべきであり、好ましくは2重量%以下、最も好ましくは1重量%以下の水を含有して、組成物自体が3

-20-

重量%以下の水を含有するのを保証する。

本発明の組成物中に存在するアルコールの量は、10~99.9%であって、好ましい量は組成物の製品の形態に依存する。例えば組成物をエアゾル容器から分配するような場合には、アルコール量は、このような製品中に一般的に存在する推進剤を包含する組成物の10~85重量%であるのが通常である。組成物をローラーオンディスペンサーから分配するような場合にはアルコールは組成物の20~98重量%であるのが通常であり、組成物が固形棒状である場合にはアルコールは組成物の10~80重量%が通常である。

追加成分

本発明のアルコール組成物は、感湿性カプセルを組成物全体に均等に拡散させて保持するか又は少し攪拌して組成物全体に容易に拡散させるように保持するかを保証するために必要によっては懸濁剤を含有することができる。

アルコール組成物がエアゾル製品又はローラーオンといった液体の場合には、懸濁剤は好ましくは疎水処理をした粘土であって、この粘土の好ましいクラスには、モンモリロナイト、ヘクトライト及びコロイド性ケイ酸アルミニウムマグネシウムといった縁粘土が含まれる。

モンモリロナイトは、それを主成分とするペントナイトから得られるコロイド性含水ケイ酸アルミニウムである。ペントナイトについての詳細は、Interscience Publishers発行のthe Kirk-Othmer Encyclopedia of Chemical Technology、第2版、Vol.3(1964)pp.339~360に見ることができる。

ヘクトライト、更に縁粘土は、格子構造中のアルミニウムがマグネシウムによってほぼ完全に置換されており、更にリチウム及びフッ素を含有することでモンモリロナイトとは異なる。

ケイ酸アルミニウムマグネシウムは、アルミニウムよりもマグネシウムが豊富なコロイド性ケイ

酸アルミニウムマグネシウムの結体である。疎水処理をしたケイ酸アルミニウムマグネシウムはR T Vanderbilt Co.製VEEGUN PROの商品名で市販されている。

本発明に必要なによっては使用するのに適した好ましい懸濁剤は、商品名BENTONEで入手可能な疎水性粘土である。BENTONESは、陽イオン交換系中で適当な粘土をアミンと反応させることによって調製される。異なるアミンを反応させると種々のBENTONESが得られるが、更にSi、Mg及びAl₂O₃の割合を変えることもできる。有効なBENTONE懸濁剤の例としてはステアラルコニウムヘクトライトであるBENTONE-27;クォータニウム(quaternium)18ペントナイトであるBENTONE-34;クォータニウム18ヘクトライトであるBENTONE-38を挙げることができるが、いずれの粒径も5ミクロン未満であり、NL Industries Inc.によって市販されている。他の適当なBENTONE粘土にはBENTONE SDI及び

-23-

BENTONE SD2がある。

更に適当な粘土は、商品名PERCHEN及びTIXOGELの疎水処理をした縁粘土である。特定の例としてはPERCHEN粘土44,97及び108とTIXOGEL VZとを挙げることができる。疎水処理をした粘土の更なるクラスにはホルマイト粘土があり、その例としては商品名PERCHEN DNAの疎水性改質アクバルジャイト粘土がある。PERCHEN粘土は英国エセックスのPerchem Limited of Harlowが販売しており、TIXOGELは英国チェシャーのProduction Chemicals Limited of Stockportが販売している。

その他の有効な懸濁剤はケイ素微粉末、特にAEROSIL及びCAB-O-SILの名で市販されている蒸散ケイ素(fumed silicas)と、ヒドロキシプロピルセルロース(KLUCEL)と、他のポリマー増粘剤である。

懸濁剤は混合して使用することもできる。

本発明の組成物中に存在することができる懸濁

-24-

剤の量は、通常0.2~20重量%、好ましくは0.5~12重量%である。

本発明のアルコール組成物は、更にその特性を強化するために他の任意の特別付入成分を含有することもできる。任意成分の例としては、組成物を発汗抑制剤として使用するための発汗抑制剤及び/若しくは抗コリン作用薬、並びに、組成物を脱臭剤として使用するための静菌剤及び/若しくは殺菌剤を挙げることができる。発汗抑制剤、抗コリン作用薬、静菌剤及び殺菌剤の例は皮膚に有益性を提供することができるカプセル内に含まれる物質として前記したものと同一である。

本発明の組成物は(エアゾル製品に対しては)液化ガス推進剤、(棒状製品に対しては)ステアリン酸ナトリウム、アテアリアルアルコール及びジベンジルソルビトールといった凝固剤、並びに皮膚緩和剤を必要によっては含有することができる。

アルコール組成物の調製方法

更に本発明は、エタノール、イソアロパノール又はこれらの混合物から選択されるアルコール中に感湿性カプセルを懸濁させるステップと、次いでこのように得られる組成物を包装するステップとから成る、本発明のアルコール組成物を製造する方法にも関する。

感湿性カプセルは、前記のように、通常の噴霧乾燥法によって調製することができる。

組成物の種類及び形態

本発明のアルコール組成物は、ヒトの皮膚に直接施用するような脱臭又は発汗抑制組成物であるのが好ましい。髭剃り使用製品、コロン水、ボディスプレー及びスキンモイスチャライザーといった体を手入れする製品中に使用することもできる。

組成物は、消費者の都合に合った形態に包装することができる。

組成物の製品形態の例としては以下のものがある。

- i) 好ましくは揮発性成分の蒸発を低減又は防止するために実質的に気密である適当な容器内に包含される押し上げ又は巻き上げ式の固体棒状物、
- ii) 液体又はゲル状のアルコール組成物を含有するローラーボールアプリーケータ、
- iii) 本発明の組成物の濃縮物と液化ガス推進剤とを含有する容器に入れた推進剤ベースのエアゾル製品、及び
- iv) 推進剤を含有しない液体又はゲル状の本発明のアルコール組成物を包含する手押し式ポンプ又はスチーズスプレー容器。

組成物の使用

本発明の組成物は通常の方法でヒトの皮膚に施用されて、例えば脱臭剤及び/又は発汗抑制剤として作用する。

施用したときにはアルコール組成物中の感湿性カプセルは、組成物のアルコール成分中に存在する封入非水性物質の15重量%以下、好ましくは10

-27-

重量%以下、理想的には1重量%以下がそのままであるべきである。

施用したときに皮膚が比較的乾燥していると仮定すると、感湿性カプセルはそのままであるが、皮膚に水分が現れる、例えば皮膚表面に汗が最初に現れたときに封入特殊ポリマーが破壊又は溶解されてカプセル内の非水性物質が放出される。この非水性物質が香料又はクーラントを含有する場合には、顕著な芳香又は冷感として少なくとも組成物の使用者にはその存在が明らかであって、脱臭剤及び/又は発汗抑制剤として組成物が意図されたように機能していることを示している。非水性物質がその他の皮膚に有益な物質を含有している場合には、水分に接触した際にそれらが放出されると同様に皮膚への有益性が知見できる。

感湿性カプセルのアルコール中での安定性を測定する方法

感湿性カプセルから抽出される香料の割合の測定

-28-

約1gの感湿性カプセルと10gの無水エタノール(即ち0.3%以下の水を含有するエタノール)とを包含するガラス管にしっかりと蓋をし、20℃で30日間一定の振拌を続けた。

1~10重量%の水を含有するアルコールを用いたその他のサンプルも比較のために調製した。

濾過によって固体感湿性カプセルから液相を分離すると、濾液中に残っている粒子材料はその香料含有量に対して無視し得る程になった。孔径0.22 μ mのミリポア材(Hillipore filters)は、本明細書中のデータを提供するのに使用する感湿性カプセルを保持するのに十分であった。しかし、感湿性カプセルが十分量の微粒子を含有している場合には上記一次条件を満足するためにより小さい孔径の試験を必要とすることもある。この条件は、最初の濾液を2つに分割することによって検証される。一方の半分ではそれ以上の処理をせずに香料含有量を分析する。他方の半分は、

0.025 μ mの篩材を用いて更に篩過した後に分析する。溶液の2つの面分の香料濃度が等しいならば条件は満足されている。

分離した液相中の香料の量は、気相クロマトグラフィー(GC)分析から得られるピーク領域によって決定される。定量化は、無水エタノール中及び各無水エタノール/水混合物中に既知の量の香料を含有する標準のピーク領域に基づいている。分析は、(共にエタノールピークを除いた)主ピーク又はトータルトレースに基づいてもよい、分析の主条件は、分析用に選択されるピークが香料に係する全領域の50%以上に分布せねばならないことである。

割合抽出は、溶液中の香料の濃度と、感湿性カプセル及び使用した無水エタノール(又は無水エタノール/水混合物)の正確な重量と、当初感湿性カプセルの香料の合計含有量の情報とから算出した。

感湿性カプセルの香料の合計含有量は、既知の重量の感湿性カプセルを適当な溶剤に完全に溶解し、同じ溶剤中の適当な基準に対するそれとGCピーク領域を比較することによって決定する。

留意点:

1. 正確に計量する—抽出成分 ± 0.01 g、
—香料基準値 ± 0.001 g、
2. ガラス管—180mm x 13mm内径、
—PTFEラインドねじ蓋で蓋をしたものの、
3. 攪拌器—Baird and Tallockテスト管回転器、
4. GC分析条件、
カラム—2m x 1/8" OD ステンレススチール、
パッキング—Chromosorb W, HP上10% カルボワックス 20H、100/120メッシュ
温度—60℃から毎分5℃ずつ200℃まで上昇させて、最後に200℃に20分間維持する、
気体キャリアー—30ml/分のヘリウム

-31-

検知器—フレイムイオン化。

当業者には公知のその他の適当なカラム及び条件でも等価の結果が得られる。

封入材料として好ましい特殊ポリマーを使用する上記方法を用いて以下の結果が得られた。

-32-

	抽出エタノール中に含有する香料(%)	30日後に抽出された香料(%)
ENCAPSUL 855	0	10
	1	14
	4	54
	5	81
	10	85
アラビアゴム	0	8
	1	8
	4	20
	5	31
	10	85
CAPSUL STARCH	0	71
	1	87
	4	92
	5	93
	10	103
市販香料封入物	0	101
	1	100
	4	97
	5	98
	10	103

上記表において、水を全く含有しない又は1重量%の水を含有するエタノールを用いて抽出したサンプルは本発明の例証であり、その他の4重量%、5重量%又は10重量%の水を含有するエタノール(即ち水性エタノール)を用いて抽出したサンプルは本発明の範囲外であって、水性エタノールに暴露されたときの封入物の固有の不安定性を例示するものである。

更に、本発明の特殊ポリマーの例である Encapsul 855及びアラビアゴムを用いて得られる結果は、中に封入された香料の大部分が水の含有量とは無関係にアルコール中に抽出された Capsul starch及び市販の香料封入物のような本発明に属さない場合とは対照をなしている。

上記方法は、非水性物質が非香料物質である感湿性カラムのアルコール中での安定性を測定するのに適用することもできる。これは、殺菌剤、スキンクーラント、皮膚緩和剤、発汗抑制剤、抗コ

リン作用素及び、抽出アルコール中に浸出されるカプセル内に包含されるその他の物質に適当な分析方法を使用することによって為される。

実施例

以下の実施例により本発明を説明する。

各々の実施例においては特殊ポリマーとしてアラビアゴム又は Encapsul 855を使用し、ポリマー28重量%、香料7重量%及び水85重量%を含有するエマルジョンを噴霧乾燥することによって封入を実施した。

実施例1

この実施例は、アルコール脱臭剤を含む本発明のエアゾル組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	1
無水エタノール(RRグレード)	28
Bentone 38	0.5
ミリスチン酸イソプロピル	0.5

-35-

Arcton 11	42
Arcton 12	<u>28</u>
	100

実施例2

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のロールオン組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	5
無水エタノール(RRグレード)	89.4
Bentone 38	8
Dowanol DPN(DPCME)	15
尿素	<u>2.8</u>
	100

実施例3

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のスティック組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	5

-37-

-36-

無水エタノール(RRグレード)	56
プロピレングリコール	36
ジベンジルソルビトール	2
Klucel H	<u>1</u>
	100

実施例4

この実施例はアルコール脱臭剤を含み発汗抑制性をもつ本発明のエアゾル組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	1
活性化塩酸アルミニウム (活性発汗抑制剤)	4
1重量%の水を含有するエタノール	10
Bentone 38	1.5
Arcton 11	50.3
Arcton 12	<u>33.2</u>
	100

実施例5

-54-

-38-

この実施例はアルコール脱臭剤を含み発汗抑制性をもつ本発明のロールオン組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	5
塩酸アルミニウムジルコニウム	25
(活性発汗抑制剤)	
0.5重量%の水を含有するエタノール	44.4
Bentone 38	8
Dowanol DPH(DPGHE)	15
尿素	<u>2.6</u>
	100

実施例6

この実施例はアルコール脱臭剤を含み発汗抑制性をもつ本発明のスティック組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	5
ジルコニルアルミニウムグリシン	22
(活性発汗抑制剤)	

-39-

	重量%
ベルガモットAD 430	8.00
p-1-酢酸ブチルシクロヘキシル	4.30
シトロネラ油	6.00
フタル酸ジエチル	8.25
エチルバニリン	0.20
イソ-オイグノール	5.00
Green Herbal AB502	15.00
2-n-ヘプチルシクロペンタノン	0.50
インドール	1.50
Isomyl formate	5.00
LRG201	1.25
α -イソ-メチルヨノン	5.00
β -ナフトールメチルエーテル	7.50
ノナンジオール-1,3-ジアセテート	4.00
パッチュリ油	7.00
酢酸フェニルエチルフェニル	5.00
Rosalia AB 380	6.00

-41-

無水エタノール(RRグレード)	35
Bentone 38	5
Fluid AP	6
尿素	2
ステアリルアルコール	<u>25</u>
	100

実施例7

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のエアゾル組成物を示す。

成分	重量%
脱臭香料を封入したEncapsul 855	1
0.2重量%の水を含有するエタノール	28
Bentone 38	0.5
ミリスチン酸イソプロピル	0.5
Arlon 11	42
Arlon 12	<u>28</u>
	100

脱臭香料は以下のごとく調合した。

-40-

Sandalone	4.00
Tetrahydro angelol	6.00
γ -ウンデカラクトン	<u>0.50</u>
	100.00

実施例8

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のロールオン組成物を示す。

成分	重量%
メントール(清涼剤)を封入した	
Encapsul 855	5
無水エタノール(RRグレード)	69.4
Bentone 38	8
Dowanol DPH(DPGHE)	15
尿素	<u>2.6</u>
	100

実施例9

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のスティック組成物を示す。

-42-

成分	重量%
メンチルピロリドンカルボキシレート (清涼剤)を封入したEncapsul 855	5
2重量%の水を含有するエタノール	56
プロピレングリコール	36
ジベンジルソルビトール	2
Klucel M	1
	100

実施例10

この実施例はアルコール脱臭剤を含み発汗抑制性をもつ本発明のエアゾル組成物を示す。

成分	重量%
Irgasan DP300を封入したEncapsul 855	1
AACH*(活性発汗抑制剤)	4
無水エタノール(RRグレード)	15
Bentone 38	1.5
Arcton 11	48.3
Arcton 12	30.2

-43-

液を噴霧乾燥して調製された尿素と特殊活性形態の塩化アルミニウム(AACH-前項参照)とのプレフォーム複合体。

実施例12

この実施例はアルコール脱臭剤を含み発汗抑制性をもつ本発明のスティック組成物を示す。

成分	重量%
香料封入Encapsul 855	5
ジルコニルアルミニウムグリシン (活性発汗抑制剤)	22
3重量%の水を含有するエタノール	35
Bentone 38	5
Fluid AP	6
尿素	2
ステアリアルアルコール	25
	100

実施例13

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明の

-45-

*米国特許第4359456号に従って調製した特殊活性形態の塩化アルミニウムの噴霧乾燥粉末。この粉末は粒度<75 μ で亜族アルミニウム含量は20%を上回る。

実施例11

この実施例はアルコール脱臭剤を含み発汗抑制性をもつ本発明のロールオン組成物を示す。

成分	重量%
臭化水素酸ベンゾイルスコボラミン を封入したEncapsul 855	5
AACH/尿素複合体*(活性発汗抑制剤)	25
無水エタノール(RRグレード)	44.4
Bentone 38	8
Dowanol DPM(DPGME)	15
尿素	2.6
	100

*AACHと尿素とを(モル比2:1で)水に同時溶解し溶

-44-

エアゾル組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	1
無水エタノール(RRグレード)	27.8
Irgasan DP38	0.1
Bentone 38	0.5
ミリスチン酸イソプロピル	0.5
Arcton 11	42
Arcton 12	28
	100

実施例14

この実施例はアルコール発汗抑制剤を含む本発明のロールオン組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	5
1重量%の水を含有するエタノール	69.35
臭化水素酸ベンゾイルスコボラミン (発汗抑制剤)	0.05

-46-

Denlone 38	8
Dowanol DPN(DPCNE)	15
尿素	<u>2.6</u>
	100

実施例15

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のエアゾル組成物を示す。

成分	重量%
香料封入アラビアゴム	1
無水エタノール(RRグレード)	28.5
ミリスチン酸イソプロピル	0.5
Arclon 11	42
Arclon 12	<u>28</u>
	100

実施例16

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のロールオン組成物を示す。

成分	重量%
----	-----

香料+Irgasan DP300を封入した	
アラビアゴム	5
2重量%の水を含有するエタノール	69.4
Denlone 38	8
Dowanol DPN(DPCNE)	15
尿素	<u>2.6</u>
	100

実施例17

この実施例はアルコール脱臭剤を含む本発明のスティック組成物を示す。

成分	重量%
香料+乳酸メンチル(清涼剤)を封入したEncapsul 855	5
2.5重量%の水を含有するエタノール	50
プロピレングリコール	30
ジベンジルソルビトール	2
Klucel H	<u>1</u>
	100

出願人 スエリッパ・ナムロービ
代理人 弁理士 川口 義雄
代理人 弁理士 中村 至
-48- 代理人 弁理士 船山 武